

Rec'd PCT/PTO 27 APR 2005  
10/532770

# VERTRAG ÜBER INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

REC'D 29 NOV 2004

WIPO

PCT



## PCT

### INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT (Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0000054068	<b>WEITERES VORGEHEN</b> siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/PEA/416)	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 03/12772	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 14.11.2003	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 15.11.2002
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK A01N43/90		
Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al		

- Dieser internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.
- Dieser BERICHT umfaßt insgesamt 6 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.  
  
☐ Außerdem liegen dem Bericht ANLAGEN bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geändert wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT).  
  
 Diese Anlagen umfassen insgesamt Blätter.

- Dieser Bericht enthält Angaben zu folgenden Punkten:
  - ☒ Grundlage des Bescheids
  - ☐ Priorität
  - ☐ Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erfinderische Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
  - ☐ Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
  - ☒ Begründete Feststellung nach Regel 66.2 a)ii) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
  - ☐ Bestimmte angeführte Unterlagen
  - ☐ Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
  - ☐ Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags  28.05.2004	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  29.11.2004
Name und Postanschrift der mit der internationalen Prüfung beauftragten Behörde   Europäisches Patentamt - P.B. 5818 Patentlaan 2 NL-2280 HV Rijswijk - Pays Bas Tel. +31 70 340 - 2040 Tx: 31 651 epo nl Fax: +31 70 340 - 3016	Bevollmächtigter Bediensteter  Muellners, W Tel. +31 70 340-3289 

**I. Grundlage des Berichts**

1. Hinsichtlich der **Bestandteile** der internationalen Anmeldung (*Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigelegt, weil sie keine Änderungen enthalten (Regeln 70.16 und 70.17)*):

**Beschreibung, Seiten**

1-12 in der ursprünglich eingereichten Fassung

**Ansprüche, Nr.**

1-10 in der ursprünglich eingereichten Fassung

2. Hinsichtlich der **Sprache**: Alle vorstehend genannten Bestandteile standen der Behörde in der Sprache, in der die internationale Anmeldung eingereicht worden ist, zur Verfügung oder wurden in dieser eingereicht, sofern unter diesem Punkt nichts anderes angegeben ist.

Die Bestandteile standen der Behörde in der Sprache: zur Verfügung bzw. wurden in dieser Sprache eingereicht; dabei handelt es sich um:

- ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen Recherche eingereicht worden ist (nach Regel 23.1(b)).
  - ☐ die Veröffentlichungssprache der internationalen Anmeldung (nach Regel 48.3(b)).
  - ☐ die Sprache der Übersetzung, die für die Zwecke der internationalen vorläufigen Prüfung eingereicht worden ist (nach Regel 55.2 und/oder 55.3).
3. Hinsichtlich der in der internationalen Anmeldung offenbarten **Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz** ist die internationale vorläufige Prüfung auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt worden, das:
- ☐ in der internationalen Anmeldung in schriftlicher Form enthalten ist.
  - ☐ zusammen mit der internationalen Anmeldung in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
  - ☐ bei der Behörde nachträglich in schriftlicher Form eingereicht worden ist.
  - ☐ bei der Behörde nachträglich in computerlesbarer Form eingereicht worden ist.
  - ☐ Die Erklärung, daß das nachträglich eingereichte schriftliche Sequenzprotokoll nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung im Anmeldezeitpunkt hinausgeht, wurde vorgelegt.
  - ☐ Die Erklärung, daß die in computerlesbarer Form erfassten Informationen dem schriftlichen Sequenzprotokoll entsprechen, wurde vorgelegt.
4. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:
- ☐ Beschreibung,      Seiten:
  - ☐ Ansprüche,      Nr.:
  - ☐ Zeichnungen,      Blatt:
5. ☐ Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2(c)).

*(Auf Ersatzblätter, die solche Änderungen enthalten, ist unter Punkt 1 hinzuweisen; sie sind diesem Bericht beizufügen.)*

6. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

**V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

- |                                |                    |
|--------------------------------|--------------------|
| 1. Feststellung                |                    |
| Neuheit (N)                    | Ja: Ansprüche 1-10 |
|                                | Nein: Ansprüche    |
| Erfinderische Tätigkeit (IS)   | Ja: Ansprüche 1-10 |
|                                | Nein: Ansprüche    |
| Gewerbliche Anwendbarkeit (IA) | Ja: Ansprüche 1-10 |
|                                | Nein: Ansprüche:   |

2. Unterlagen und Erklärungen:

**siehe Beiblatt**

**Zu Punkt V**

**Begründete Feststellung hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung**

Es wird auf die folgenden im internationalen Recherchenbericht zitierten  
Entgegenhaltungen verwiesen:

- D1 WO 98/46607 A
- D2 EP 988790 A
- D3 WO99/31981 A
- D4 WO 97/10716 A
- D5 US 5593996 A
- D6 WO 02/56688 A

**Neuheit**

Die vorliegende Anmeldung erfüllt das Erfordernis des Artikels 33(1) PCT in Verbindung mit Artikel 33(2) PCT, weil der Gegenstand der Ansprüche 1-10 neu ist.

Gegenstand des unabhängigen Anspruches 1 ist eine fungizide Mischung aus einem spezifischen fungiziden Triazolopyrimidin (im folgenden TP1 genannt) und N-Biphenyl-nikotinamiden in einer synergistisch wirksamen Menge. Die übrigen unabhängigen Ansprüche 6 und 10 richten sich auf ein Verfahren zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen mittels einer solchen Mischung, bzw. auf die Verwendung der beiden Verbindungen zur Herstellung von Mitteln zur Bekämpfung von Schadpilzen.

Keine der genannten Entgegenhaltungen offenbart die spezifische Mischung, die Gegenstand der vorliegenden Anmeldung ist.

D1 offenbart u.a. die Verbindung TP1 und ihre Wirksamkeit gegen pflanzenpathogene Pilze wie z.B. *Botrytis cinerea* und erwähnt die Möglichkeit der Mischung mit anderen Fungiziden.

D2 offenbart synergistische Mischungen von Triazolopyrimidinen mit anderen Fungiziden, wie z.B. mit Strobilurinen und Azolen.

D3 offenbart synergistische Mischungen von fungiziden N-Biphenyl-nikotinamiden, wie z.B. die als Boscalid (oder Nicobifen) bekannte Verbindung des Anspruches 3 der vorliegenden Anmeldung, mit fungiziden Dicarboximiden oder 2-Phenylamino-

pyrimidinen.

D4 offenbart synergistische Mischungen von fungiziden N-Biphenyl-nikotinamiden, wie z.B. Boscalid mit fungiziden Inhibitoren des Cytochrom-Komplexes III, wie z.B. den sogenannten Strobilurinen.

D5 zeigt die Wirksamkeit von Triazolopyrimidinen, wie sie in D2 verwendet werden gegen pflanzenpathogene Schadpilze wie *Botrytis sp.*.

D6 schließlich offenbart synergistische Mischungen von fungiziden N-Biphenyl-nikotinamiden, wie z.B. Boscalid mit fungiziden Benzophenonen zur Bekämpfung von pflanzenpathogenen Schadpilzen, wie z.B. *Sphaerotheca sp.*.

### **Erfinderische Tätigkeit**

Die vorliegende Anmeldung erfüllt die Erfordernisse des Artikels 33(1) PCT in Verbindung mit Artikel 33(3) PCT, weil der Gegenstand der Ansprüche 1-10 auf einer erfinderischen Tätigkeit beruht.

Im Lichte der Beschreibung und des nächsten Standes der Technik der Entgegenhaltung D1 kann als die der Anmeldung zugrundeliegende Aufgabe die Bereitstellung synergistischer Mischungen von Triazolopyrimidinen mit anderen Fungiziden angesehen werden,

Die vorgeschlagene Lösung ist durch die Verwendung des spezifischen Triazolopyrimidins TP1 in Kombination mit N-(Biphenyl)-nikotinamide, wie z.B. Boscalid gekennzeichnet.

Der nächste Stand der Technik offenbart, dass bestimmte 2,4,6-Trifluorophenyl-triazolopyrimidine gute Wirksamkeit gegen u.a. *Botrytis* zeigen, wobei TP1 gegen *Botrytis*, das wirksamste scheint. Es wird auf die Entgegenhaltung D5 als eine frühere Veröffentlichung dieser allgemeinen Substanzklasse verwiesen gegenüber denen die hier in D1 ausgewählten vermutlich als überlegen gelten sollen. Außerdem wird Mischung mit anderen Fungiziden vorgeschlagen, die möglicherweise zu einem synergistischen Effekt führen können. N-(Biphenyl)-nikotinamide, werden aber nicht spezifisch genannt.

Um zum Anmeldungsgegenstand zu kommen, ist es notwendig spezifisch sowohl unter den Triazolopyrimidinen von D1 dasjenige der vorliegenden Anmeldung zu wählen als auch als Partner N-(Biphenyl)-nikotinamide, statt eine der in D1 aufgelisteten Verbindungen zu nehmen. Die zusätzliche Information von D2 kann weder das eine

noch das andere nahelegen, da es andere Triazolopyrimidine wählt und N-Biphenyl-nikotinamide, wie z.B. Boscalid, gar nicht erwähnt.

Mutatis mutandis ausgehend von D2 musste wiederum das Triazolopyrimidin gewählt werden und darüber hinaus die dort gewählten Partner durch die völlig anderen N-(Biphenyl)-nikotinamide ersetzen werden. Dafür bestand keine Veranlassung, ganz zu schweigen, dass man einen synergistischen Effekt erwartet hätte.

D3, D4 und D6 erfordern den Ersatz völlig andersartiger Fungizide durch TP1. Das Pyrimidin-Strukturelement im Cyprodinil etc. von D3, ist eine viel zu geringfügige Übereinstimmung, um den Fachmann vergleichbare Eigenschaften erwarten zu lassen. Die Strobilurine von D4 und die Benzophenone von D6 sind völlig ohne strukturellen Bezug.

Das die beanspruchten Kombinationen synergistische Wirkung zeigen würden war vom Fachmann deshalb nicht vorauszusehen.

#### **Industrielle Anwendbarkeit**

Der Gegenstand der Ansprüche 1-10 wird als industriell anwendbar erachtet (Artikel 33(1) and (4) PCT).

Translation

Rec'd PCT/PTO 27 APR 2003

PATENT COOPERATION TREATY

PCT/EP2003/012772



PCT 10/532770

INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY  
(Chapter II of the Patent Cooperation Treaty)

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference 0000054068	FOR FURTHER ACTION	See Form PCT/IPEA/416
International application No. PCT/EP2003/012772	International filing date (day/month/year) 14 November 2003 (14.11.2003)	Priority date (day/month/year) 15 November 2002 (15.11.2002)
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC A01N 43/90		
Applicant BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

1. This report is the international preliminary examination report, established by this International Preliminary Examining Authority under Article 35 and transmitted to the applicant according to Article 36.
2. This REPORT consists of a total of 6 sheets, including this cover sheet.
3. This report is also accompanied by ANNEXES, comprising:
  - a. ☐ (sent to the applicant and to the International Bureau) a total of \_\_\_\_\_ sheets, as follows:
    - ☐ sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis of this report and/or sheets containing rectifications authorized by this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions).
    - ☐ sheets which supersede earlier sheets, but which this Authority considers contain an amendment that goes beyond the disclosure in the international application as filed, as indicated in item 4 of Box No. I and the Supplemental Box.
  - b. ☐ (sent to the International Bureau only) a total of (indicate type and number of electronic carrier(s)) \_\_\_\_\_, containing a sequence listing and/or tables related thereto, in computer readable form only, as indicated in the Supplemental Box Relating to Sequence Listing (see Section 802 of the Administrative Instructions).
4. This report contains indications relating to the following items:

<input checked="" type="checkbox"/> Box No. I	Basis of the report
<input type="checkbox"/> Box No. II	Priority
<input type="checkbox"/> Box No. III	Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability
<input type="checkbox"/> Box No. IV	Lack of unity of invention
<input checked="" type="checkbox"/> Box No. V	Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement
<input type="checkbox"/> Box No. VI	Certain documents cited
<input type="checkbox"/> Box No. VII	Certain defects in the international application
<input type="checkbox"/> Box No. VIII	Certain observations on the international application

Date of submission of the demand 28 May 2004 (28.05.2004)	Date of completion of this report 29 November 2004 (29.11.2004)
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## INTERNATIONAL PRELIMINARY REPORT ON PATENTABILITY

International application No.

PCT/EP2003/012772

## Box No. I Basis of the report

1. With regard to the language, this report is based on the international application in the language in which it was filed, unless otherwise indicated under this item.

- ☐ This report is based on translations from the original language into the following language \_\_\_\_\_, which is language of a translation furnished for the purpose of:
- ☐ international search (under Rules 12.3 and 23.1(b))
- ☐ publication of the international application (under Rule 12.4)
- ☐ international preliminary examination (under Rules 55.2 and/or 55.3)

2. With regard to the elements of the international application, this report is based on *(replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to this report)*:

- ☒ The international application as originally filed/furnished
- ☒ the description:
- pages \_\_\_\_\_ 1-12 \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☒ the claims:
- pages \_\_\_\_\_ 1-10 \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_, as amended (together with any statement) under Article 19
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings:
- pages \_\_\_\_\_, as originally filed/furnished
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- pages\* \_\_\_\_\_ received by this Authority on \_\_\_\_\_
- ☐ a sequence listing and/or any related table(s) – see Supplemental Box Relating to Sequence Listing.

3. ☐ The amendments have resulted in the cancellation of:

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

4. ☐ This report has been established as if (some of) the amendments annexed to this report and listed below had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

- ☐ the description, pages \_\_\_\_\_
- ☐ the claims, Nos. \_\_\_\_\_
- ☐ the drawings, sheets/figs \_\_\_\_\_
- ☐ the sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_
- ☐ any table(s) related to sequence listing (*specify*): \_\_\_\_\_

\* If item 4 applies, some or all of those sheets may be marked "superseded."



## INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT

International application No.

PCT/EP 03/12772

## V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement

## 1. Statement

Novelty (N)	Claims	1-10	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1-10	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims	1-10	YES
	Claims		NO

## 2. Citations and explanations

Reference is made to the following international search report citations:

D1: WO 98/46607 A

D2: EP 988790 A

D3: WO 99/31981 A

D4: WO 97/10716 A

D5: US 5593996 A

D6: WO 02/56688 A

**Novelty**

The present application satisfies the requirement of PCT Article 33(1) in conjunction with PCT Article 33(2), because the subject matter of claims 1 to 10 is novel.

The subject matter of independent claim 1 is a fungicidal mixture of a specific fungicidal triazolopyrimidine (hereinafter referred to as TP1) and N-biphenyl nicotinamides in a synergistically effective amount. The other independent claims 6 and 10 are directed to a method for the control of phytopathogenic harmful fungi using a mixture of this kind and to the use of the two compounds for the production of agents for the control of harmful fungi, respectively.

None of the above citations discloses the specific mixture forming the subject matter of the present application.

D1 discloses *inter alia* the compound TP1 and its efficacy against phytopathogenic fungi such as *Botrytis cinerea*; D1 also mentions the possibility of its being mixed with other fungicides.

D2 discloses synergistic mixtures of triazolopyrimidines with other fungicides such as strobilurins and azoles.

D3 discloses synergistic mixtures of fungicidal N-biphenyl nicotinamides, such as the compound known as boscalid (or nicobifen) in claim 3 of the present application, with fungicidal dicarboximides or 2-phenylaminopyrimidines.

D4 discloses synergistic mixtures of fungicidal N-biphenyl nicotinamides such as boscalid with fungicidal inhibitors of the cytochrome complex III, such as the ingredients known as strobilurins.

D5 demonstrates the efficacy of triazolopyrimidines as used in D2 against phytopathogenic harmful fungi such as *Botrytis sp.*

Lastly, D6 discloses synergistic mixtures of fungicidal N-biphenyl nicotinamides such as boscalid with fungicidal benzophenones for the control of phytopathogenic harmful fungi such as *Sphaerotheca sp.*

#### **Inventive step**

The present application satisfies the requirements of PCT Article 33(1) in conjunction with PCT Article 33(3), because the subject matter of claims 1 to 10 involves an

inventive step.

In the light of the description and the closest prior art in citation D1, the problem addressed by the application can be considered that of providing synergistic mixtures of triazolopyrimidines with other fungicides.

The proposed solution is characterised by the use of the specific triazolopyrimidine TP1 in combination with N-biphenyl nicotinamides such as boscalid.

The closest prior art document discloses that certain 2,4,6-trifluorophenyl-triazolopyrimidines exhibit good efficacy against, *inter alia*, *Botrytis* and that TP1 appears to be the most effective of these compounds against *Botrytis*. Said document refers to citation D5 as an earlier publication of this general class of substances, to which the compounds selected here in D1 are presumably to be considered superior. Also proposed is mixing with other fungicides, which might lead to a synergistic effect. N-biphenyl nicotinamides are not, however, specifically mentioned.

To arrive at the subject matter of the application, the triazolopyrimidine in the present application has to be specifically selected from the D1 triazolopyrimidines, and N-biphenyl nicotinamides have to be specifically selected as the other component instead of one of the compounds listed in D1. The additional information in D2 cannot render one or the other obvious, since D2 selects other triazolopyrimidines and does not even mention N-biphenyl nicotinamides such as boscalid.

Proceeding from D2 *mutatis mutandis* the triazolopyrimidine again had to be selected and, moreover, the other

components selected therein had to be replaced by the completely different N-biphenyl nicotinamides. There was no reason to do this, let alone to expect a synergistic effect.

D3, D4 and D6 require the replacement of totally different kinds of fungicides by TP1. The pyrimidine structural element in the cyprodinil, etc. in D3 is far too dissimilar for a person skilled in the art to expect comparable properties. The D4 strobilurins and the D6 benzophenones are structurally completely unrelated.

A skilled person was therefore unable to foresee that the claimed combinations would exhibit a synergistic effect.

#### **Industrial applicability**

The subject matter of claims 1 to 10 is considered to be industrially applicable (PCT Article 33(1) and (4)).